

Érvényes

Ügyszám: P9300376

Bejelentés napja: 1993.02.12

Adatközlés napja: 1993.04.28

Közzétételi szám: 70035

Közzététel napja: 1995.09.28

Lajstromszám: 218950

Megadás napja: 2000.10.26

Megadás meghirdetése: 2001.01.29

Uniós elsőbbség: JP059347/92 - 1992.02.12

Módosítási elsőbbség napja: 1994.07.01

NSZO: C07D47104; C07D47114; A61K 31436; A61K 314375; A61P 2500; A61K 314365; C07D49514; C07D491147

Cím: Kondenzált imidazo-piridin-származékok, az ezeket tartalmazó gyógyszerkészítmények és eljárás előállításukra

Angol cím: CONDENSED IMIDAZO PYRIDINE DERIVATIVES, PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING THEM AND PROCESS FOR THEIR PREPARATION

Jogosult: Shionogi and Co. Ltd., Osaka (JP)

Feltaláló: Matsushita, Akira, Higashinada-ku, Kobe-shi (JP)

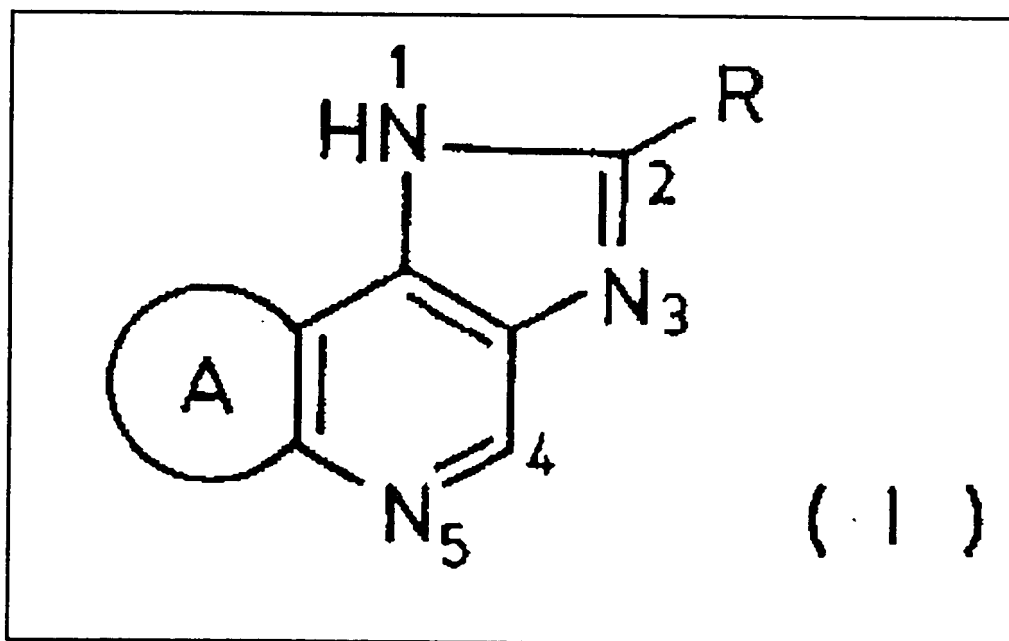
Sasatani, Takashi, Nara-shi, Nara-ken (JP)

Takada, Susumu, Kawanishi-shi, Hyogo-ken (JP)

Chomei, Nobuo, Sakai-shi, Osaka-fu (JP)

Adachi, Makoto, Ikoma-gun, Nara-ken (JP)

Képviselő: Kerény Judit, DANUBIA Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft., Budapest (HU)



#### Kivonat (megadási):

A találmány tárgyát (I) általános képletű vegyületek - ahol R jelentése adott esetben halogénatommal, 1-7 szénatomos alkil- vagy alkoxicsoporttal szubsztituált fenilcsoport, vagy adott esetben 1-7 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált izoxazol-3- vagy 5-il- vagy

szubsztituálatlan tienil-, furil- vagy piridilcsoport, az A gyűrű 5-7 tagú aliciklusos vagy 6 tagú heterociklusos gyűrű, mely a piridingyűrűvel közös szénatomot kivéve telített, és a heterogyűrű egy oxigén-, kénatomot, S, SO<sub>2</sub> vagy -NR<sub>1</sub> csoportot tartalmazhat, ahol R<sub>1</sub> jelentése az alkilrészben 1-7 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, és az A gyűrű adott esetben 1 vagy 2 metilcsoporttal szubsztituált - és sói, valamint eljárás előállításukra és az ezeket tartalmazó gyógyszerkészítmények képezik. Az (I) általános képletű vegyületek pszichotropikus szerként, például szorongásgátlóként, anesztéziaantagonista szerként vagy agyműködés-aktiválóként használhatók.

### *Igéypont:*

1. (I) általános képletű vegyület - ahol R jelentése adott esetben halogénatommal, 1-7 szénatomos alkil- vagy alkoxicssoporttal szubsztituált fenilcsoport, vagy adott esetben 1-7 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált izoxazol-3- vagy 5-il-, vagy szubsztituálatlan tienil-, furil- vagy piridilcsoport, az A gyűrű 5-7 tagú aliciklusos vagy 6 tagú heterociklusos gyűrű, mely a piridingyűrűvel közös szénatomot kivéve telített, és a heterogyűrű egy oxigén-, kénatomot, SO, SO<sub>2</sub> vagy -NR<sub>1</sub> csoportot tartalmaz, ahol R<sub>1</sub> jelentése az alkilrészben 1-7 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, és az A gyűrű adott esetben 1 vagy 2 metilcsoporttal szubsztituált - vagy sója.
2. Az 1. igénypont szerinti vegyület, ahol R jelentése adott esetben 1-7 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált izoxazolilcsoport.
3. Az 1. vagy 2. igénypont szerinti vegyület, ahol az A gyűrű dihidro-tio-pirano-, ciklohexeno- vagy dihidropirano-gyűrű.
4. Az 1. igénypont szerinti vegyület, amely 2-(3-izoxazolil)-1,6,7,9-tetrahidro-imidazo[4,5-d]pira- no[4,3-b]piridin vagy sója.
5. Gyógyszerkészítmény, amely egy 1. igénypont szerinti vegyületet vagy sóját tartalmazza hatóanyagként megfelelő hordozóval vagy segédanyagokkal összekeverve.
6. Az 5. igénypont szerinti készítmény mint pszichotropikus rendellenességek elleni szer.
7. Az 5. igénypont szerinti készítmény, mint szorongásgátló szer.
8. Az 5. igénypont szerinti készítmény mint anesztéziaantagonista szer.
9. Az 5. igénypont szerinti készítmény mint agyműködés-aktivátor.
10. Eljárás (I) általános képletű vegyület - ahol R jelentése adott esetben halogénatommal, 1-7 szénatomos alkil- vagy alkoxicssoporttal szubsztituált fenilcsoport, vagy adott esetben 1-7 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált izoxazol-3- vagy 5-il-, vagy szubsztituálatlan tienil-, furil- vagy piridilcsoport, az A gyűrű 5-7 tagú aliciklusos vagy 6 tagú heterociklusos gyűrű, mely a piridingyűrűvel közös szénatomot kivéve telített, és a heterogyűrű egy oxigén-, kénatomot, SO, SO<sub>2</sub> vagy -NR<sub>1</sub> csoportot tartalmaz, ahol R<sub>1</sub> jelentése az alkilrészben 1-7 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, és az A gyűrű adott esetben 1 vagy 2 metilcsoporttal szubsztituált - és sói előállítására, azzal jellemezve, hogy a) egy (II2) általános képletű vegyületet gyűrűbe zárunk - ahol R és az A gyűrű jelentése a fenti, vagy a2) egy (III1) általános képletű vegyületet R csoport bevitelére alkalmas reagenssel acilezünk, majd a kapott vegyületet gyűrűbe zárjuk, ahol R és az A gyűrű jelentése a fenti, vagy b) egy (III3) általános képletű vegyületet, ahol R és az A gyűrű jelentése a fenti, gyűrűbe zárunk, és a kapott terméket kívánt esetben sóvá alakítjuk, vagy az a-b) eljárással kapott sóból az (I) képletű vegyületet kívánt esetben felszabadítjuk.
11. Eljárás gyógyszerkészítmények előállítására, azzal jellemezve, hogy egy 10. igénypont szerint előállított (I) általános képletű vegyületet vagy sóját, ahol A és R jelentése az 1. igénypont szerinti, gyógyászatiilag elfogadható hordozókkal összekeverünk, és

gyógyszerkészítménnyé alakítunk.

### ***Intézkedések***

#### **0. Adatközlés (A0)**

*Intézkedés kelte:* 1993.04.28 *meghirdetése:* 1993.04.28 (AA1A Adatközlés szabadalmi bejelentésekről)

#### **7. Szabadalmi bejelentés közzététele (CV)**

*Intézkedés kelte:* 1995.07.26 *meghirdetése:* 1995.09.28 (BB9A Szabadalmi bejelentések közzététele)

#### **13. Szabadalom megadása (BZ)**

*Intézkedés kelte:* 2000.10.26 *átvétele:* 2000.12.15 *meghirdetése:* 2001.01.29 (FG4A Megadott szabadalmak)

#### **14. Szabadalmi okirat megküldése (CB)**

*Intézkedés kelte:* 2001.04.02 *meghirdetése:* 2001.05.28 (SC4A Nyomtatásban megjelent szabadalmi leírások)